

医薬品インタビューフォーム

日本病院薬剤師会のIF記載要領（1998年9月）に準拠して作成

持続型 α_1 ブロッカー-排尿障害改善剤・降圧剤	
処方箋医薬品 ^{注)}	ハイトラシン錠 0.25mg <small><テラゾシン塩酸塩水和物錠></small>
処方箋医薬品 ^{注)}	ハイトラシン錠 0.5mg <small><テラゾシン塩酸塩水和物錠></small>
処方箋医薬品 ^{注)}	ハイトラシン錠 1mg <small><テラゾシン塩酸塩水和物錠></small>
処方箋医薬品 ^{注)}	ハイトラシン錠 2mg <small><テラゾシン塩酸塩水和物錠></small>
注) 注意一医師等の処方箋により使用すること	Hytracin[®]

剤	形	錠 剤
規 格 ・ 含	量	ハイトラシン錠 0.25 mg : 1錠中テラゾシンとして0.25 mg含有 ハイトラシン錠 0.5 mg : 1錠中テラゾシンとして0.5 mg含有 ハイトラシン錠 1 mg : 1錠中テラゾシンとして1 mg含有 ハイトラシン錠 2 mg : 1錠中テラゾシンとして2 mg含有
一 般	名	和 名 : テラゾシン塩酸塩水和物 洋 名 : Terazosin Hydrochloride Hydrate (JAN) Terazosin (INN)
製 造 販 売 承 認 年 月 日		製造販売承認 : 1989年3月31日
薬 価 基 準 収 載 年 月 日		薬価基準収載 : 1989年5月26日
発 売 年 月 日		発 売 : 1989年7月17日 (0.25 mg, 0.5 mg, 1 mg) 1991年5月13日 (2 mg)
開 発 ・ 製 造 販 売 (輸 入) ・ 提 携 ・ 販 売 会 社 名		製造販売元 : マイランEPD合同会社
担 当 者 の 連 絡 先 ・ 電 話 番 号 ・ F A X 番 号		

本IFは2017年2月改訂の添付文書の記載に基づき改訂した。

I F 利用の手引きの概要—日本病院薬剤師会—

1. 医薬品インタビューフォーム作成の経緯

当該医薬品について製薬企業の医薬情報担当者（以下、MRと略す）等にインタビューし、当該医薬品の評価を行うのに必要な医薬品情報源として使われていたインタビューフォームを、昭和63年日本病院薬剤師会（以下、日病薬と略す）学術第2小委員会が「医薬品インタビューフォーム」（以下、I Fと略す）として位置付けを明確化し、その記載様式を策定した。そして、平成10年日病薬学術第3小委員会によって新たな位置付けとI F記載要領が策定された。

2. I Fとは

I Fは「医療用医薬品添付文書等の情報を補完し、薬剤師等の医療従事者にとって日常業務に必要な医薬品の適正使用や評価のための情報あるいは薬剤情報提供の裏付けとなる情報等が集約された総合的な医薬品解説書として、日病薬が記載要領を策定し、薬剤師等のために当該医薬品の製薬企業に作成及び提供を依頼している学術資料」と位置付けられる。しかし、薬事法の規制や製薬企業の機密等に関わる情報、製薬企業の製剤意図に反した情報及び薬剤師自らが評価・判断・提供すべき事項等はI Fの記載事項とはならない。

3. I Fの様式・作成・発行

規格はA4判、横書きとし、原則として9ポイント以上の字体で記載し、印刷は一色刷りとする。表紙の記載項目は統一し、原則として製剤の投与経路別に作成する。

I Fは日病薬が策定した「I F記載要領」に従って記載するが、本I F記載要領は、平成11年1月以降に承認された新医薬品から適用となり、既発売品については「I F記載要領」による作成・提供が強制されるものではない。また、再審査及び再評価（臨床試験実施による）がなされた時点ならびに適応症の拡大等がなされ、記載内容が大きく異なる場合にはI Fが改訂・発行される。

4. I Fの利用にあたって

I F策定の原点を踏まえ、MRへのインタビュー、自己調査のデータを加えてI Fの内容を充実させ、I Fの利用性を高めておく必要がある。

MRへのインタビューで調査・補足する項目として、開発の経緯、製剤的特徴、薬理作用、臨床成績、非臨床試験等の項目が挙げられる。また、随時改訂される使用上の注意等に関する事項に関しては、当該医薬品の製薬企業の協力のもと、医療用医薬品添付文書、お知らせ文書、緊急安全性情報、Drug Safety Update（医薬品安全対策情報）等により薬剤師等自らが加筆、整備する。そのための参考として、表紙の下段にI F作成の基となった添付文書の作成又は改訂年月を記載している。なお適正使用や安全確保の点から記載されている「臨床成績」や「主な外国での発売状況」に関する項目等には承認外の用法・用量、効能・効果が記載されている場合があり、その取扱いには慎重を要する。

目 次

I. 概要に関する項目	1
1. 開発の経緯	1
2. 製品の特徴及び有用性	1
II. 名称に関する項目	2
1. 販売名	2
2. 一般名	2
3. 構造式又は示性式	2
4. 分子式及び分子量	2
5. 化学名	2
6. 慣用名, 別名, 略号, 記号番号	2
7. CAS 登録番号	2
III. 有効成分に関する項目	3
1. 有効成分の規制区分	3
2. 物理化学的性質	3
3. 有効成分の各種条件下における安定性	3
4. 有効成分の確認試験法	4
5. 有効成分の定量法	4
IV. 製剤に関する項目	5
1. 剤形	5
2. 製剤の組成	5
3. 懸濁剤, 乳剤の分散性に対する注意	5
4. 製剤の各種条件下における安定性	6
5. 調製法及び溶解後の安定性	6
6. 他剤との配合変化(物理化学的変化)	6
7. 混入する可能性のある夾雑物	6
8. 溶出試験	6
9. 生物学的試験法	6
10. 製剤中の有効成分の確認試験法	6
11. 製剤中の有効成分の定量法	6
12. 力価	6
13. 容器の材質	6
14. その他	6

V. 治療に関する項目	7
1. 効能又は効果	7
2. 用法及び用量	7
3. 臨床成績	7
VI. 薬効薬理に関する項目	13
1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群	13
2. 薬理作用	13
VII. 薬物動態に関する項目	14
1. 血中濃度の推移・測定法	14
2. 薬物速度論的パラメータ	15
3. 吸収	15
4. 分布	15
5. 代謝	16
6. 排泄	17
7. 透析等による除去率	17
VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目	19
1. 警告内容とその理由	19
2. 禁忌内容とその理由	19
3. 効能・効果に関連する使用上の注意とその理由	19
4. 用法・用量に関連する使用上の注意とその理由	19
5. 慎重投与内容とその理由	19
6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法	20
7. 相互作用	20
8. 副作用	21
9. 高齢者への投与	30
10. 妊婦，産婦，授乳婦等への投与	30
11. 小児等への投与	30
12. 臨床検査結果に及ぼす影響	31
13. 過量投与	31
14. 適用上及び薬剤交付時の注意（患者等に留意すべき必須事項等）	31
15. その他の注意	31
16. その他	32

IX. 非臨床試験に関する項目	33
1. 一般薬理	33
2. 毒性	33
X. 取扱い上の注意等に関する項目	35
1. 有効期間又は使用期限	35
2. 貯法・保存条件	35
3. 薬剤取扱い上の注意点	35
4. 承認条件	35
5. 包装	35
6. 同一成分・同効薬	35
7. 国際誕生年月日	35
8. 製造販売承認年月日及び承認番号	35
9. 薬価基準収載年月日	36
10. 効能・効果追加, 用法・用量変更追加等の年月日及びその内容	36
11. 再審査結果, 再評価結果公表年月日及びその内容	36
12. 再審査期間	36
13. 長期投与の可否	36
14. 厚生労働省薬価基準収載医薬品コード	36
15. 保険給付上の注意	36
XI. 文献	37
1. 引用文献	37
2. その他の参考文献	38
XII. 参考資料	39
主な外国での発売状況	39
XIII. 備考	40
その他の関連資料	40

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

アボット ラボラトリーズ（米国）は、1975年にキナゾリン系化合物の中から、2位の置換基に4-テトラヒドロフロイル-1-ピペラジニル（4-tetrahydrofuroyl-1-piperazinyl）基を有するテラゾシン塩酸塩水和物が、著明な降圧作用を有することを発見した。その後の基礎的検討から、本剤の降圧作用が α_1 遮断作用に基づくことを確認し、既存の α_1 遮断薬 プラゾシン塩酸塩に比べ血漿中薬物消失半減期が長く、降圧作用に持続性が期待出来ることを見出した。1983年にFDA（米国）に申請を行い、1987年に承認を得た。

本邦においては1977年より前臨床試験を開始し、安全性を確認するとともに、本剤が末梢血管抵抗を減少させることにより、1日2回投与にて持続的かつ安定した降圧作用が得られることなどを検討した。そして軽症から重症までの本態性高血圧症の他、褐色細胞腫による高血圧症、腎性高血圧症において優れた有用性が確認され、1989年3月に承認を得た。

また、本剤は基礎的検討で前立腺肥大症に伴う排尿障害を改善することが示唆され、1989年より臨床試験を開始した。その結果、前立腺、尿道及び膀胱頸部の α_1 受容体を選択的に遮断して前立腺部尿道の緊張を緩和し、尿流動態の改善、自覚症状（排尿困難、夜間頻尿、残尿感など）の改善が確認され、1994年10月に効能追加が承認された。

2. 製品の特徴及び有用性

本態性高血圧症、腎性高血圧症、褐色細胞腫による高血圧症

- ・降圧作用は、シナプス後の α_1 受容体を選択的に遮断による全末梢血管抵抗の減少による。
- ・作用発現は、緩徐であり、安定した持続性の降圧効果が得られる。
- ・本態性高血圧症のほか、腎性高血圧症、褐色細胞腫による高血圧症にも使用できる。
- ・心拍数、心拍出量、レニン活性に及ぼす影響は少なく耐性は見られない。

前立腺肥大症に伴う排尿障害

- ・前立腺、尿道及び膀胱頸部の α_1 受容体を選択的に遮断し、尿道内圧を低下させて排尿障害（尿流動態）を改善する。
- ・尿流動態を速やかに、持続的に改善する。
- ・排尿困難、夜間頻尿、残尿感などの自覚症状を改善する。

副作用

- ・本態性高血圧症、腎性高血圧症、褐色細胞腫による高血圧症
総症例10,626例中、292例（2.75%）に副作用が認められ、主な副作用はめまい（ふらつき感等を含む）58件（0.55%）、立ちくらみ41件（0.39%）、動悸（心悸亢進を含む）35件（0.33%）、頭痛（頭重感等を含む）35件（0.33%）であった。（再審査終了時）
- ・前立腺肥大症に伴う排尿障害
総症例5,761例中、336例（5.83%）に副作用が認められ、主な副作用はめまい（ふらつき感を含む）138件（2.40%）、立ちくらみ111件（1.93%）、貧血（赤血球減少等を含む）25件（0.43%）、低血圧（血圧降下等を含む）21件（0.36%）であった。（再審査終了時）
- ・重大な副作用として
意識喪失（頻度不明）、肝機能障害（0.1%未満）、黄疸（頻度不明）があらわれることがある。

II. 名称に関する項目

1. 販売名

(1) 和名

ハイトラシン錠 0.25 mg

ハイトラシン錠 0.5 mg

ハイトラシン錠 1 mg

ハイトラシン錠 2 mg

(2) 洋名

Hytracin Tablets 0.25 mg

Hytracin Tablets 0.5 mg

Hytracin Tablets 1 mg

Hytracin Tablets 2 mg

(3) 名称の由来

本邦に先がけて発売されていた、海外での販売名 Hytrin (ハイトリン) にちなむ。

2. 一般名

(1) 和名 (命名法)

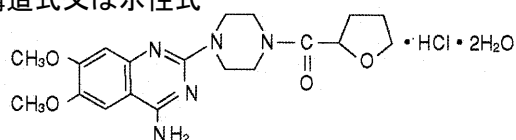
テラゾシン塩酸塩水和物 [JAN]

(2) 洋名 (命名法)

Terazosin Hydrochloride Hydrate [JAN]

Terazosin (INN)

3. 構造式又は示性式



4. 分子式及び分子量

分子式：C₁₉H₂₅N₅O₄ · HCl · 2H₂O

分子量：459.93

5. 化学名

(±)-4-amino-2-[4-(tetrahydro-2-furoyl)-1-piperazinyl]-6,7-dimethoxyquinazoline hydrochloride dihydrate

6. 慣用名, 別名, 略号, 記号番号

A-45975, MY-208 (治験番号)

7. CAS 登録番号

70024-40-7

Ⅲ. 有効成分に関する項目

1. 有効成分の規制区分

処方箋医薬品（本有効成分を含有する製剤）

2. 物理化学的性質

(1) 外観・性状

本品は白色～微黄白色の結晶性の粉末で、においはない。

水溶液（1→100）のpHは3.5～4.5である。

(2) 溶解性

水又は氷酢酸にやや溶けにくく、メタノール、エタノール又はクロロホルムに溶けにくく、無水酢酸に極めて溶けにくく、アセトン又はエーテルにほとんど溶けない。

(3) 吸湿性

室温、相対湿度0～93%で16日間放置したが、吸湿性及び結晶水の脱離は認められなかった。

(4) 融点（分解点）、沸点、凝固点

融点：約260℃（分解）

(5) 酸塩基解離定数

pKa=7.05

(6) 分配係数

pH	2.0	4.0	6.0	8.0	10.0
分配率 $\left(\frac{\text{クロロホルム}}{\text{緩衝液}} \right)$	5/95	35/65	97/3	98/2	97/3

(7) その他の主な示性値

旋光性：本品の水溶液（1→100）は旋光性がない。

3. 有効成分の各種条件下における安定性

(1) 各種条件下における安定性

試験の種類	保存条件	保存形態	保存期間	結果	
長期保存試験	室温	白色ポリエチレン瓶	36ヵ月	変化なし	
加速試験	40℃, 75%RH	無色ガラス瓶 (開放)	6ヵ月	変化なし	
苛酷試験	温度	50℃	無色ガラス瓶 (開放)	6ヵ月	変化なし
		40℃	無色ガラス瓶 (開放)	6ヵ月	変化なし
	湿度	25℃, 90%RH	ガラス製シャーレ (開放)	6ヵ月	変化なし
	光	室内散光※1	ガラス製シャーレ (開放)	6ヵ月	わずかに分解物 (PAD)が認められた
蛍光灯照射※2		ガラス製シャーレ (開放)	120万 lux・hr	わずかに分解物 (PAD)が認められた	

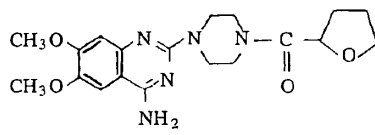
試験項目：外観、融点、確認試験、純度試験（溶状、薄層クロマトグラフィー）、含量

※1 1日平均800lux, 7時間照射

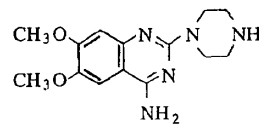
※2 白色蛍光灯の近接照射（6000lux, 庫内温度33～36℃）

(2) 強制分解による生成物

光，酸又はアルカリ条件下で加水分解され薄層クロマトグラムにおいて分解物（PAD）が認められた。



(テラゾシン)



(PAD)

4. 有効成分の確認試験法

- (1) 第三アミンの確認試験法
- (2) 塩酸塩の確認試験法
- (3) 紫外可視吸光度測定法
- (4) 赤外吸収スペクトル法

5. 有効成分の定量法

液体クロマトグラフィー

IV. 製剤に関する項目

1. 剤形

(1) 剤形の区別及び性状

①剤形：錠（素錠）

②性状：

商品名	表面・裏面	側面	外観・色調	直径	厚さ	重量
ハイトラシン錠 0.25 mg			白 色	7.0 mm	3.0 mm	0.15 g
ハイトラシン錠 0.5 mg			白 色 割線入り			
ハイトラシン錠 1 mg						
ハイトラシン錠 2 mg						

(2) 製剤の物性

該当資料なし

(3) 識別コード

ハイトラシン錠 0.25 mg : 片面に M, もう一方の片面に 21 が刻印されている.

ハイトラシン錠 0.5 mg : 片面に M, もう一方の片面に 22 が刻印されている.

ハイトラシン錠 1 mg : 片面に M, もう一方の片面に 23 が刻印されている.

ハイトラシン錠 2 mg : 片面に M, もう一方の片面に 24 が刻印されている.

(4) pH, 浸透圧比, 粘度, 比重, 無菌の旨及び安定な pH 域等

該当しない

(5) 酸価, ヨウ素価等

該当しない

2. 製剤の組成

(1) 有効成分（活性成分）の含量

ハイトラシン錠 0.25 mg : 1 錠中テラゾシンとして 0.25 mg 含有する.

ハイトラシン錠 0.5 mg : 1 錠中テラゾシンとして 0.5 mg 含有する.

ハイトラシン錠 1 mg : 1 錠中テラゾシンとして 1 mg 含有する.

ハイトラシン錠 2 mg : 1 錠中テラゾシンとして 2 mg 含有する.

(2) 添加物

ポビドン, タルク, ステアリン酸マグネシウム, トウモロコシデンプン, 乳糖水和物

3. 懸濁剤, 乳剤の分散性に対する注意

該当しない

4. 製剤の各種条件下における安定性

試験の種類	保存条件	保存形態	保存期間	結果
加速試験	40°C, 75%RH	PTP 包装, 紙箱	6 ヶ月	変化なし

試験項目：性状，確認試験，製剤均一性，溶出性，定量

5. 調製法及び溶解後の安定性

該当しない

6. 他剤との配合変化（物理化学的变化）

該当しない

7. 混入する可能性のある夾雑物

安定性試験（加速試験）において分解物の生成は認められない。

8. 溶出試験

局外規「テラゾシン塩酸塩水和物錠」の溶出試験による。すなわち，試験液に水 900mL を用い，溶出試験法パドル法により毎分 50 回転で試験を行うとき，15 分間の溶出率は 80% 以上である。

9. 生物学的試験法

該当しない

10. 製剤中の有効成分の確認試験法

- (1) 第三アミンの確認試験法
- (2) 紫外可視吸光度測定法

11. 製剤中の有効成分の定量法

液体クロマトグラフィー

12. 力価

本剤は力価表示に該当しない。

13. 容器の材質

PTP 包装：ポリ塩化ビニルフィルム，アルミ箔

14. その他

該当しない

V. 治療に関する項目

1. 効能又は効果

- (1) 本態性高血圧症，腎性高血圧症，褐色細胞腫による高血圧症
- (2) 前立腺肥大症に伴う排尿障害

2. 用法及び用量

(1) 本態性高血圧症，腎性高血圧症，褐色細胞腫による高血圧症

テラゾシンとして通常，成人 1 日 0.5 mg（1 回 0.25 mg 1 日 2 回）より投与を始め，効果が不十分な場合は 1 日 1～4 mg に漸増し，1 日 2 回に分割経口投与する。

なお，年齢，症状により適宜増減するが，1 日最高投与量は 8 mg までとする。

(2) 前立腺肥大症に伴う排尿障害

テラゾシンとして通常，成人 1 日 1 mg（1 回 0.5 mg 1 日 2 回）より投与を始め，1 日 2 mg に漸増し，1 日 2 回に分割経口投与する。

なお，症状により適宜増減する。

3. 臨床成績

(1) 臨床効果

①本態性高血圧症，腎性高血圧症，褐色細胞腫による高血圧症

承認時までに実施された臨床試験における，降圧効果を指標とした有効率は次のとおりであった。

対象疾患名	有効率 (%) [下降以上]	有効率 (%) [やや下降以上]
本態性高血圧症 ^{1~4)}	64.8% (380/586)	84.6% (496/586)
腎性高血圧症 ⁵⁾	52.6% (20/38)	76.3% (29/38)
褐色細胞腫による高血圧症 ⁶⁾	64.7% (11/17)	100% (17/17)

また，本態性高血圧症については，重症例においても有効であり，また 1 年以上の長期投与例においても安定した降圧効果を示した。また，二重盲検比較試験により単独投与及び降圧利尿剤との併用投与において，本剤の有用性が認められている。

②前立腺肥大症に伴う排尿障害^{7~10)}

承認時までに実施された臨床試験における，自覚症状及び尿流動態（最大尿流量率，平均尿流量率）を指標とした有効率は次のとおりであった。

対象疾患名	有効率 (%) [改善以上]	有効率 (%) [やや改善以上]
前立腺肥大症に伴う排尿障害	52.2% (181/347)	81.3% (282/347)

(2) 臨床薬理試験：忍容性試験^{11, 12)}

健常成人男子 6 名を対象として 1 回投与及び 12 日間の反復投与試験が実施され，テラゾシン塩酸塩水和物の安全性と薬物動態並びに薬理作用に関する検討が行われた。

①1 回投与試験

6名（平均年齢 32.8 歳，平均体重 67.9 kg）に初回 0.5 mg を，以後 1 mg，2 mg を投与した．各投与の間は 2 週間の Wast out 期間をおき漸増した．なお，増量に際しては前投与量の安全性を確認の上，実施した．

自覚症状は，0.5 mg 投与時に脱力感，1 mg 投与時に頭痛，目のまわりのほてり感，2 mg 投与時に鼻閉感・頭重感・動悸・立ちくらみを訴えたが，いずれも軽度であり，特に処置することなく消失した．

②反復投与試験

1 回投与試験と同一の被験者に対し，0.5 mg，1 mg，2 mg を 12 時間の間隔で 1 日 2 回，各用量 4 日間ずつ，低用量より漸増し計 12 日間反復投与した．

自覚症状は，0.5 mg 投与時に動悸・ボーッとする感じ，1 mg 投与時にめまい感・倦怠感，胃部圧迫感，2 mg 投与時に下痢・胃部膨満感・腹痛を訴えたが，いずれも軽度であり，特に処置することなく消失した．

臨床検査では，3 例に軽度 ALT（GPT）の増加を認めたが，投与終了後正常化した．

以上の 1 回投与試験並びに反復投与試験により，テラゾシン塩酸塩水和物の安全性に問題はないものと考えられた．

(3) 探索的試験：用量反応探索試験¹³⁾

本態性高血圧症の入院患者を対象に，テラゾシン塩酸塩水和物 1 日 1 回投与と 1 日 2 回投与の血圧日内変動に及ぼす影響を検討した．

本態性高血圧症 29 例（1 日 1 回投与 15 例，1 日 2 回投与 14 例）について検討した．安全性の評価は全例を対象とし，血圧日内変動の評価は観察期血圧 150/90 mm Hg 以上の 21 例（1 日 1 回投与 11 例，1 日 2 回投与 10 例）を対象とした．平均投与期間は 14.5 日，平均投与量は 3.1 mg/日，最高投与量は 8 mg/日であった．

1 回投与，2 回投与とも治療期において持続的な血圧下降が認められた．日内変動の標準偏差，日内較差は，2 回投与の拡張期血圧と脈拍数に有意な減少が認められた以外，特に有意な変動は認められなかった．1 回投与では投与 2，4 時間後に降圧効果が強くあらわれたので，1 日 2 回投与が望ましいと考えられた．

(4) 検証的試験

1) 無作為化平行用量反応試験

[1] 高血圧症¹⁴⁾

用法・用量は海外における臨床試験成績，ヒトにおける生体内薬物動態及び類薬であるプラゾシン塩酸塩の用量を参考とし，初回用量を 1 mg/日（朝・夕分 2）とし最高用量を 6 mg/日（分 2）とする群と，初回用量を 0.5 mg/日（分 2）とし，最高用量を 4 mg/日（分 2）とする群にて fixed-flexible dose schedule 法を用いて検討した．

214 例に対する検討の結果，単独投与においては，0.5 mg/日開始群にて約 56%の降圧効果を認め，1 mg/日開始群に比べめまい，立ちくらみ等の発現が少ないことが示

唆された。また、併用投与においては0.5 mg/日開始群にて約51%の降圧効果を認め、1 mg/日開始群に比べ副作用の発現率が低いことが認められた。用法・用量としては、1回0.25 mg 1日2回より投与を開始し4 mg/日までの増量で十分な降圧効果が得られ、また症例によっては6 mg/日への増量も可能であった。

〔2〕 前立腺肥大症に伴う排尿障害⁷⁾

海外では、本剤の前立腺肥大症に対する用量と高血圧症に対する用量とがほぼ同じである。一方、本邦においても本剤の本態性高血圧症での二重盲検比較試験で対照薬として用いたプラゾシン塩酸塩が、前立腺肥大症に伴う排尿障害における用量と高血圧症に対する用量とがほぼ同じであった。そこで、本試験では、本剤の本態性高血圧症における平均投与量である2 mg/日を高用量群（H群）とし、その半量である1 mg/日を低用量群（L群）とした2群間の比較試験を行った。また、投与初期の副作用発現を考慮し投与1週目は導入期として各群半量の1 mg/日又は0.5 mg/日を投与した。

用法については、既承認の本態性高血圧症と同様に1日2回、朝夕の内服とした。161例に対する検討の結果、本剤の前立腺肥大症に伴う排尿障害に対する有用性が確認され、以下の理由から至適用量としてH群の2 mg/日が選択された。

イ) 自覚症状改善度はL群38.0%に対しH群43.9%、全般改善度はL群39.4%に対しH群51.5%と有意差はなかったがいずれもH群が高値を示した。

ロ) 最大尿流量率、平均尿流量率では群間に有意な差はなかったが、H群の方が改善が大きかった。

ハ) 最大尿流量率ノモグラムの改善を観察期グレードで層別すると症状の重い症例ではH群の改善率がL群に比し高値を示した。

ニ) 副作用発現率は両群ともほぼ同じ程度であり、ともに臨床上問題となるものではないと考えられた。

ホ) 有用率はL群42.5%に対し、H群48.6%と有意差はなかったが、H群が高値を示した。

2) 比較試験

〔1〕 高血圧症

本態性高血圧患者を対象とする比較試験、二重盲検比較試験において、本剤の有効性が認められた^{2, 15)}。

〔2〕 前立腺肥大症に伴う排尿障害

前立腺肥大症に伴う排尿障害を有する患者232例を対象とする二重盲検比較試験において、本剤の有効性が認められた⁸⁾。

3) 安全性試験

〔1〕 高血圧症

本態性高血圧症患者82例を対象に、テラゾシン塩酸塩水和物0.5~6 mg/日（分2）を単独投与試験、降圧利尿剤との併用投与試験とに分けて、1年以上の投与を目標に長期投与試験を行ったところ、1年以上の長期投与においても安定した降圧効果

の持続が認められた。副作用は82例中3例(3.7%)に立ちくらみ、下腿浮腫、肩こりが各1件ずつ認められた⁴⁾。

[2] 前立腺肥大症に伴う排尿障害

第Ⅱ相用量設定試験の対象患者のうち継続投与が可能な31例を対象として、テラゾシン塩酸塩水和物1ないし2mg/日(分2)(第Ⅱ相試験終了時の用法用量)で6ヵ月以上の投与を目標に継続投与し、長期投与試験を行った。

なお、十分な効果の得られないものは6mg/日まで増量可能とした。副作用は31例中1例(3.2%)に軽度の立ちくらみを認めたが減量により回復した¹⁰⁾。

以上の結果、テラゾシン塩酸塩水和物は長期連用時の安全性に問題がなく、また、本剤の効果は長期にわたり維持されることが示された。

4) 患者・病態別試験

[1] 褐色細胞腫による高血圧症に対する効果⁶⁾

〈成績〉

①対象患者と投与量

総投与例数は17例であった。17例の病態の分類は良性12例、悪性5例で、一方、発症の原因より分類するとノルアドレナリン放出型11例、ノルアドレナリン及びアドレナリン放出型6例であった。

投与量は0.25mg~8mg/日で1日1~3回投与された。効果判定時の平均投与量は3.25mg/日であった。

②血圧のコントロール

17例中11例(64.7%)に良好な血圧コントロールが可能であった。また、観察期に昇圧発作の認められた11例中、完全消失例が5例、発作の減少が4例に認められた。

③自覚症状改善度

良好な血圧コントロールが可能であった11例中10例(90.9%)に、自覚症状の改善が認められた。特に頭痛・頭重・立ちくらみなどの循環器症状の改善が認められた。

④安全度

17例中4例(23.5%)に副作用が認められた。症状としては、立ちくらみ2例、脈拍数の増加1例、AST(GOT)・ALT(GPT)の上昇1例で、いずれも軽度で投与中止例はなく、副作用のため、減量又は治療を要したものはなかった。

⑤有用度

有用以上と判定された症例は17例中15例(88.2%)であった。

以上の成績より、テラゾシン塩酸塩水和物は褐色細胞腫による高血圧症の内科的治療において、優れた効果を示し、安全性も高く、有用な薬剤であると考えられた。

[2] 重症高血圧症に対する効果³⁾

初診時の拡張期血圧が120mmHg以上で、観察期に降圧利尿剤と他の1種の降圧剤(交

感神経抑制剤又はβ遮断剤)の2剤により治療しても拡張期血圧が110 mm Hg以上を示す高血圧症を対象とした。投与期間は入院例においては4週間以上、外来例においては8週間以上とした。治療期には、観察期から投与していた2種の降圧剤の用法・用量を変更せずにテラゾシン塩酸塩水和物を追加投与した。投与は0.5 mg/日(分2)より開始し、十分な降圧効果(拡張期血圧が100 mm Hg未満に下降又は観察期血圧に比べ10 mm Hg以上下降)が得られるまで漸増した。

ただし、最高用量は6 mg/日(分2)とした。

〈成績〉

①対象患者と投与量

総投与例数は36例であった。うち2例は、プロトコール逸脱であり評価対象より除外し、34例を対象(外来30例、入院4例)とした。

効果判定時の平均投与量は、外来例2.8 mg/日、入院例4.8 mg/日であった。

②降圧効果

外来例における血圧は投与2週目より有意な下降が認められた。一方、脈拍数には特に有意な変動は認められなかった。有効率は77%であった。

③安全度

副作用発現率は7/32例(22%)に認められた。その内訳は、めまい2例、不整脈1例、頭がボーッとする感じ・胸部圧迫感・皮疹1例であった。臨床検査値の異常は、血清クレアチニン値・尿酸の上昇、AST(GOT)・LDH・CK(CPK)の上昇、血沈・CK(CPK)の上昇が各1例みられた。

④有用度

「有用」以上の有用率は、77%であった。

以上の成績より、テラゾシン塩酸塩水和物は、重症高血圧症患者に対し、軽・中等症本態性高血圧症患者と同等以上の降圧効果、安全性を示し、有用であると考えられた。

[3] 腎性高血圧症に対する効果⁵⁾

収縮期血圧160 mm Hg以上かつ拡張期血圧95 mm Hg以上で、血清クレアチニン値が1.5 mg/dL以上の腎障害を伴うものを対象とした。投与期間は、外来では12週間以上、入院例では4週間程度とした。投与はテラゾシン塩酸塩水和物0.5 mg/日(分2)より開始し、十分な降圧効果が認められるまで漸増した。ただし、最高用量は4 mg/日(分2)とした。

〈成績〉

①対象患者と投与量

血清クレアチニン値1.5 mg/dL以上の腎障害に伴う高血圧症は、44例であった。平均投与量は、全例で2.55 mg/日であった。

②降圧効果

有効率(下降以上)は、52.6%(20/38例)であった。脈拍数には特に有意な変動は認められなかった。また、腎機能の程度で層別すると、血清クレアチニン値3.0 mg/dL以下の有効率52.2%、血清クレアチニン値3.1 mg/dL以上の有効率は

53.3%であり、差はみられなかった。

③安全度

副作用発現率は22.7% (10/44例)であった。腎障害の程度との関連を検討するため、血清クレアチニン値を指標に層別すると3.0 mg/dL以下の群の発現率は11.5% (3/26例)であり、3.1 mg/dL以上の発現率は38.9% (7/18例)で、後者が有意に高い発現率であった。

副作用による中止例は4例 (3.0 mg/dL以下で1例、3.1 mg/dL以上で3例)であった。なお、血清クレアチニン値3.1 mg/dL以上の症例で、投与後の血清クレアチニン値が投与前に比し増加した症例では、個々に検討した結果、本剤の影響よりも、自然経過によるものと考えられた。

④有用度

有用率は、44.7%であった。

以上の結果より、テラゾシン塩酸塩水和物は腎性高血圧症、並びに腎障害を伴う高血圧症に対して、1日2回0.5~4 mg/日の投与で有効な降圧剤であると考えられた。ただし、血清クレアチニン値が正常に近い例 (1.5~3.0 mg/dL) では、従来の本態性高血圧症に対する報告と副作用の発現頻度は変わらなかったが、腎障害の進行した例 (3.1 mg/dL以上) では発現頻度が高かったため、高度の腎障害を伴う例では、投与量・副作用などに十分配慮することが望ましいと考えられた。

(5) 治療的使用

1) 使用成績調査・特別調査・市販後臨床試験

①使用成績調査

[1] 高血圧症

1989年3月31日から1994年3月30日までに全国866施設から収集した10,345例のうち、有効性解析対象症例9,661例における改善率は76.1% (7,350/9,661例)であった。

[2] 前立腺肥大症に伴う排尿障害

1994年11月1日から1997年10月31日までに全国774施設から収集した5,828例のうち、有効性解析対象症例5,228例における改善率は60.1% (3,144/5,228例)であった。

注) 1998年12月再審査申請時集計データ

②特別調査

該当しない

③市販後臨床試験

該当しない

2) 承認条件として実施予定の内容又は実施した試験の概要

該当しない

VI. 薬効薬理に関する項目

1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群

プラゾシン塩酸塩

ブナゾシン塩酸塩

ウラピジル

ドキサゾシンメシル酸塩

タムスロシン塩酸塩

ナフトピジル

2. 薬理作用

(1) 作用部位・作用機序

α_1 受容体遮断作用

イヌ大動脈, 脳を用いた *in vitro* 受容体結合実験で, 本剤は α_1 受容体を選択的に遮断し, シナプス前の α_2 受容体遮断作用は著しく弱い. このため, シナプス前の α_2 受容体を介するノルアドレナリン放出のネガティブフィードバック機構を阻害することなく, 末梢血管を拡張させ, ノルアドレナリンの過剰放出を起しにくくすることが認められている^{16,17)}.

また, ヒト肥大前立腺に対しても *in vitro* 受容体結合実験で α_1 受容体を選択的に遮断し, 収縮実験ではノルアドレナリンによる収縮反応を抑制した¹⁸⁾.

(2) 薬効を裏付ける試験成績

①抗高血圧作用

(1) 高血圧自然発症ラット, DOG-salt 高血圧ラット, 腎性高血圧ラット, 腎性高血圧イヌのいずれにおいても, 単回経口投与にて, 明らかな降圧作用を示し, その作用は持続的であった^{19,20)}.

(2) 高血圧自然発症ラット, 腎性高血圧イヌにおいて, 長期反復経口投与により本剤は安定した降圧作用を示し, 作用に耐性がないことが認められている^{19,20)}.

②前立腺及び尿道に対する作用

イヌ及びヒトにおいて, 単回投与により前立腺部尿道内圧を低下させ, 尿道抵抗を減少させることが認められている^{21,22)}.

③その他

(1) 高血圧自然発症ラット, 腎性高血圧イヌ並びに本態性高血圧症患者において, 全末梢血管抵抗の減少による降圧作用が認められ, 心拍出量や脈拍数に与える影響は少なかった^{19,20,23)}.

(2) 本態性高血圧症患者において体位変換による血圧の変化に対し影響を及ぼさなかった¹⁾.

VII. 薬物動態に関する項目

1. 血中濃度の推移・測定法

(1) 治療上有効な血中濃度

該当資料なし

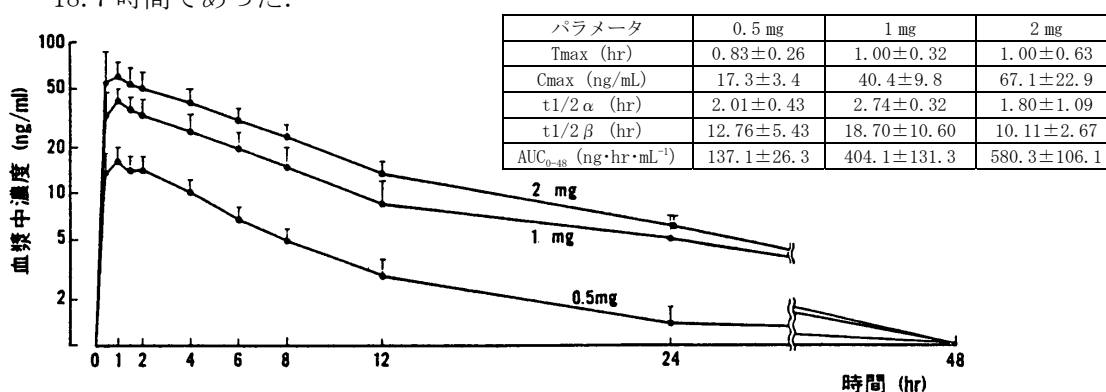
(2) 最高血中濃度到達時間²⁴⁾

1 時間 (健常成人: 0.5, 1.0, 2.0 mg各錠の単回経口投与時)

(3) 通常用量での血中濃度

① 単回経口投与¹¹⁾

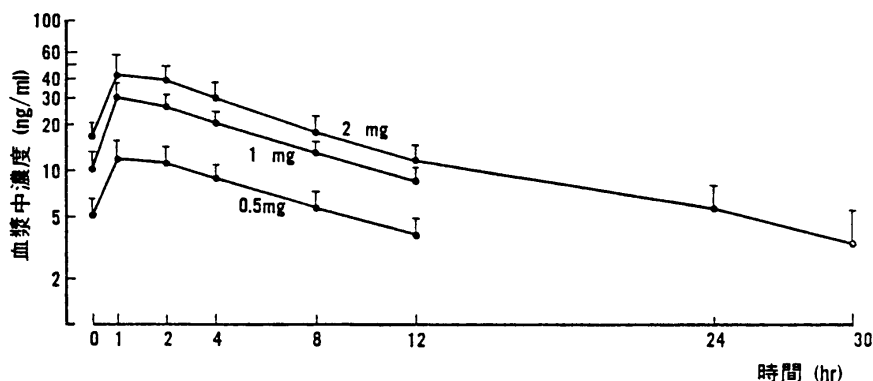
健常成人に 0.5 mg, 1 mg, 2 mg各錠を単回経口投与したときの血漿中未変化体濃度は、それぞれ投与約 1 時間後で最高値を示し、消失半減期は α 相 1.8~2.7 時間, β 相 10.1~18.7 時間であった。



ヒトに 0.5, 1, 2 mg各錠を単回経口投与したときの血漿中濃度推移(平均±S. D., n=6)

② 連続経口投与¹²⁾

健常成人にテラゾシン塩酸塩水和物を 0.5 mg, 1 mg及び 2 mgと順次 2 倍に増量し, 12 時間間隔で各 8 回, 合計 24 回連続経口投与した. 8, 16 及び 24 回投与 (各投与量での最終投与) 後の血漿中未変化体濃度は, それぞれ投与約 1 時間後で最高値を示し, Cmax は投与量にほぼ比例した. 各投与量における最終投与後の平均血漿中未変化濃度は, 投与後 12 時間にはいずれも Cmax の 26~30%の値に低下したことから, 血漿中未変化濃度の減少は投与量及び投与回数に影響されなかった. また, 連日投与後の消失半減期は 2.4 時間 (α 相) 及び 11.5 時間 (β 相) と, 単回投与時と極めて類似した消失を示した. これらのことから, 連日投与によるテラゾシン塩酸塩水和物の蓄積は小さいと推察された.



ヒトに 0.5, 1, 2 mg各錠を連続経口投与したときの血漿中濃度推移(平均±S. D., n=6)

(4) 中毒症状を発現する血中濃度

該当資料なし

2. 薬物速度論的パラメータ

(1) 吸収速度定数¹¹⁾

$3.654 \pm 2.542 \text{ hr}^{-1}$ (0.5 mg錠単回投与時)

(2) バイオアベイラビリティ

該当資料なし

(3) 消失速度定数¹¹⁾

$0.147 \pm 0.026 \text{ hr}^{-1}$ (0.5 mg錠単回投与時)

(4) クリアランス

該当資料なし

(5) 分布容積¹¹⁾

$17.67 \pm 8.05 \text{ L}$ (0.5 mg錠単回投与時)

(6) 血清蛋白結合率

ヒト：79.3～93.9%

3. 吸収

吸収部位：消化管

経路：該当資料なし

吸収率：該当資料なし

腸肝循環：関与する

4. 分布

(1) 血液－脳関門通過性

該当資料なし

〈参考〉動物でのデータ²⁴⁾

ラットに¹⁴C-テラゾシン塩酸塩水和物 1 mg/kgを単回経口投与したときの組織内放射能濃度推移において、脳への移行はほとんど認められなかった。

(2) 胎児への移行性

該当資料なし

〈参考〉動物でのデータ²⁴⁾

妊娠 18 日の雌ラットに¹⁴C-テラゾシン塩酸塩水和物 1 mg/kgを経口投与した。胎盤中には母獣血液よりも高い放射能（約 5 倍）が認められたが、胎仔中放射能濃度は母獣血液中のそれと同程度であり、胎仔血液中放射能濃度は母獣のそれよりも低値（約 1/2）を示した。

(3) 乳汁中への移行性

該当資料なし

〈参考〉動物でのデータ²⁴⁾

分娩後 14 日の雌ラットに¹⁴C-テラゾシン塩酸塩水和物 1 mg/kgを経口投与した。乳汁中放

射能濃度は投与後 6 時間に最高値 1800ng/mL を示し、同時に測定した血中濃度の 71 倍に達したが、投与後 24 時間には最高濃度の約 1/10 まで低下した。

(4) 髄液への移行性

該当資料なし

(5) その他の組織への移行性

該当資料なし

〈参考〉動物でのデータ

(i) 単回投与時の組織内濃度²⁴⁾

ラットに¹⁴C-テラゾシン塩酸塩水和物 1mg/kg を単回投与したときの各組織内放射能濃度は、投与後 3~6 時間で最高値に達した。肝臓、膀胱、副腎、脳下垂体が比較的高い放射能濃度を示したが、脳への移行は極めて低かった。また、組織からの放射能消失は速やかであった。

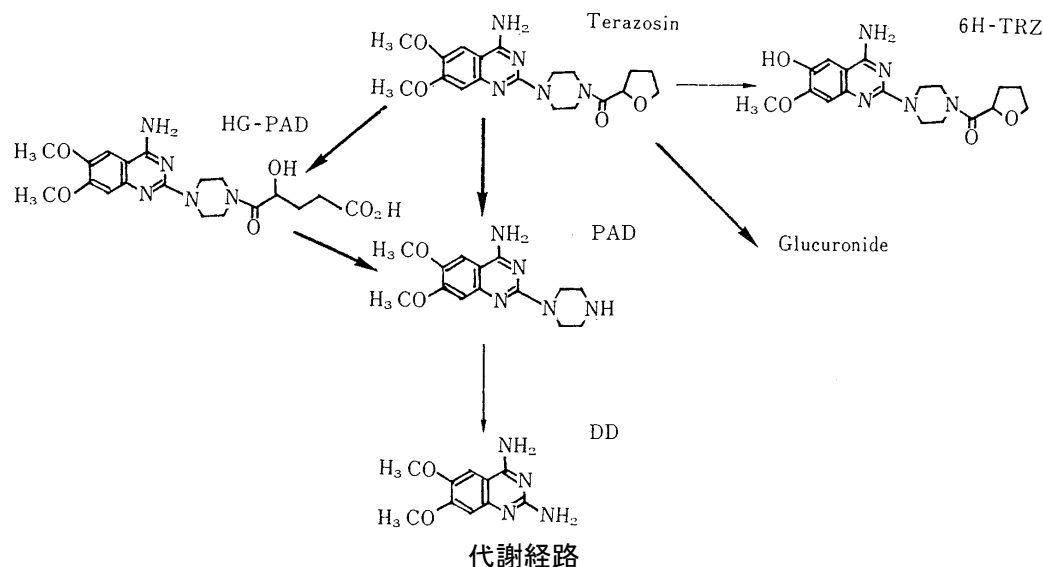
(ii) 連続経口投与時の組織内濃度

ラットに¹⁴C-テラゾシン塩酸塩水和物 1mg/kg を連続経口投与したときの各組織内放射能濃度は、単回経口投与時とほぼ同じであった。組織からの放射能の消失は連続投与により遅延する傾向を示したが、最終投与後 (21 日投与後) の全身中の放射能は、総投与量の 0.1% 以下であり、特定の臓器への蓄積は認められなかった。

5. 代謝

(1) 代謝部位及び代謝経路²⁵⁾

健常成人に 2 mg錠を経口投与したときの尿中の代謝物として、テラゾシンの N-グルクロン酸抱合体、PAD、DD、HG-PAD、6H-TRZ が検出された



(2) 代謝に関与する酵素 (CYP450 等) の分子種

該当資料なし

(3) 初回通過効果の有無及びその割合

該当資料なし

(4) 代謝物の活性の有無及び比率

該当資料なし

〈参考〉動物でのデータ

ラットの摘出大動脈条片における HG-PAD 及び DD の α 遮断作用は、それぞれテラゾシン塩酸塩水和物の約 1/20 及び 1/100 であり、PAD、6H-TRZ 及び 7H-TRZ では 1/100 以下であった。

SHR における HG-PAD 及び DD の静脈内投与による作用はそれぞれテラゾシン塩酸塩水和物の約 1/3 及び 1/30 であり、その他の代謝物ではほとんど影響が認められなかった。

(5) 活性代謝物の速度論的パラメータ

該当資料なし

6. 排泄

(1) 排泄部位

主として糞中。

(2) 排泄率

①単回経口投与²⁵⁾

健常成人に 2 mg錠を単回経口投与したとき、投与後 24 時間までに尿中に排泄された代謝物は、未変化テラゾシンが 12.9%と最も多く、次いでテラゾシンの N-グルクロン酸抱合体、PAD、HG-PAD、DD 及び 6H-TRZ であった。未変化テラゾシン及びこれらの代謝物の合計は、投与量の 25.3%であり、ヒトにおける主排泄経路は糞中排泄であると推察された。

②連続経口投与¹²⁾

健常成人にテラゾシン塩酸塩水和物を 0.5、1 及び 2 mgと、順次 2 倍に増量し、12 時間間隔で各 8 回、合計 24 回、連続経口投与した場合の最終投与後 48 時間までに尿中に排泄された未変化テラゾシンは総投与量の 16.2%であった。これは単回経口投与時とほぼ同じ尿中排泄率であり、連続経口投与によりテラゾシン塩酸塩水和物の体内動態は変化しないものと推察された。

③腎機能の低下した高血圧症患者での排泄²⁶⁾

高度に腎機能の低下した高血圧症患者にテラゾシン塩酸塩水和物 0.5 mgを単回経口投与した結果、24 時間までの未変化テラゾシンの尿中排泄量は投与量の 3.9%であった。この値は健常成人における尿中排泄率 (12.9%) に比べ少なく、腎機能低下による排泄の遅延が示唆された。

(3) 排泄速度

該当資料なし

7. 透析等による除去率

(1) 腹膜透析

該当資料なし

(2) 血液透析³⁸⁾

慢性腎不全血液透析患者を対象に、透析日、非透析日の単回投与及び4週間連続投与時の薬物動態を検討した。その結果、単回投与において透析日、非透析日の血漿中濃度推移に差は認められなかった。ダイアライザーからの除去率(4.3±2.7%)は低く、透析排液中に本剤は検出されなかった(測定限界以下)。また、4週間の連続投与により、血漿中濃度の上昇は認められず蓄積性はないと考えられた。

(3) 直接血液灌流

該当資料なし

VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

1. 警告内容とその理由

該当しない

2. 禁忌内容とその理由

■禁忌（次の患者には投与しないこと）
本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者

（解説）

本剤に過敏症の既往歴のある患者に本剤を投与した場合、重篤な過敏症状を起こす可能性がある。

3. 効能・効果に関連する使用上の注意とその理由

該当しない

4. 用法・用量に関連する使用上の注意とその理由

該当しない

5. 慎重投与内容とその理由

慎重投与（次の患者には慎重に投与すること）
(1) 重篤な肝・腎機能障害のある患者〔血中濃度が上昇するおそれがある。〕
(2) ホスホジエステラーゼ5阻害作用を有する薬剤（PDE5阻害剤）を服用している患者
〔「併用注意」の項参照〕
(3) 高齢者〔「高齢者への投与」の項参照〕

6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法

重要な基本的注意

- (1) 起立性低血圧があらわれることがあるので、臥位のみならず立位又は坐位で血圧測定を行い、体位変換による血圧変化を考慮し、坐位にて血圧をコントロールすること。
- (2) 投与初期又は用量の急増時等に、めまい、立ちくらみ、動悸、頭痛等があらわれることがある。
その際は仰臥位をとらせるなどの適切な措置を講ずること。
また、必要に応じて対症療法を行うこと。
- (3) 降圧作用に基づくめまい等があらわれることがあるので、高所作業、自動車の運転等危険を伴う機械を操作する際には注意させること。
- (4) アレルギー体質の患者では副作用発現率が高くなる傾向があるので、このような患者に投与する場合には十分に注意すること。
- (5) 本剤による前立腺肥大症に伴う排尿障害に対する治療は原因療法ではなく、対症療法であることに留意し、本剤投与により期待する効果が得られない場合には手術療法等、他の適切な処置を考慮すること。

7. 相互作用

(1) 併用禁忌とその理由

該当しない

(2) 併用注意とその理由

併用注意(併用に注意すること)		
薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
降圧作用を有する他の薬剤	降圧作用が増強することがあるので、減量するなど適切な処置を行う。	相加的に降圧作用を増強させる。
ホスホジエステラーゼ5阻害剤 (PDE5阻害剤) シルденаフィルクエン酸塩 バルデナフィル塩酸塩水和物 タダラフィル	PDE 5 阻害剤との併用により症候性低血圧があらわれるおそれがあるので、本剤を低用量から投与開始すること。	PDE 5 阻害剤は血管拡張作用を有するので、併用により降圧作用を増強させるおそれがある。

8. 副作用

(1) 副作用の概要

<p>〈本態性高血圧症，腎性高血圧症，褐色細胞腫による高血圧症〉 総症例 10,626 例中，292 例 (2.75%) に副作用が認められ，主な副作用はめまい（ふらつき感等を含む）58 件 (0.55%)，立ちくらみ 41 件 (0.39%)，動悸（心悸亢進を含む）35 件 (0.33%)，頭痛（頭重感等を含む）35 件 (0.33%) であった。（再審査終了時）</p> <p>〈前立腺肥大症に伴う排尿障害〉 総症例 5,761 例中，336 例 (5.83%) に副作用が認められ，主な副作用はめまい（ふらつき感を含む）138 件 (2.40%)，立ちくらみ 111 件 (1.93%)，貧血（赤血球減少等を含む）25 件 (0.43%)，低血圧（血圧降下等を含む）21 件 (0.36%) であった。（再審査終了時）</p>

1) 重大な副作用と初期症状

<p>重大な副作用</p> <p>1) 意識喪失（頻度不明）：血圧低下に伴う一過性の意識喪失等があらわれることがあるので，観察を十分に行い，異常が認められた場合には，投与を中止し，適切な処置を行うこと。</p> <p>2) 肝機能障害（0.1%未満），黄疸（頻度不明）：AST（GOT），ALT（GPT），A1-P，LDH の上昇等を伴う肝機能障害や黄疸があらわれることがあるので，観察を十分に行い，異常が認められた場合には，投与を中止し，適切な処置を行うこと。</p>

2) その他の副作用

<p>その他の副作用 以下のような副作用があらわれた場合には，症状に応じて適切な処置を行うこと。</p>			
	0.1～5%未満	0.1%未満	頻度不明
過敏症^{注)}	発疹	そう痒	血管浮腫
精神神経系	めまい，頭痛，倦怠感	脱力感，発汗，不眠，冷感，肩こり，眠気，口渇，しびれ	
循環器	立ちくらみ，動悸，低血圧	浮腫，不整脈（期外収縮，心房細動等），胸痛，起立性低血圧，頻脈	
肝臓	ALT（GPT）上昇	AST（GOT）上昇，A1-P 上昇，LDH 上昇，総ビリルビン上昇	
消化器	腹痛	下痢，便秘，悪心，嘔吐，食欲不振，消化不良	
泌尿器		頻尿，尿失禁	
腎臓		BUN 上昇，血中クレアチニン上昇	
その他	ほてり，貧血	鼻閉，息切れ，目の違和感，インポテンス，抗核抗体の陽性	羞明
<p>注) このような症状があらわれた場合には投与を中止し，適切な処置を行うこと。</p>			

(2) 項目別副作用発現頻度及び臨床検査値異常一覧

[副作用発現状況]

①高血圧症 (再審査終了時)

	承認時までの調査	承認時以降の調査	合 計
調査症例数	743	9,883	10,626
副作用発現症例数	111	181	292
副作用発現件数	171	226	397
副作用発現症例率 (%)	14.94	1.83	2.75
副作用の種類	種類別発現症例 (件数) 率 (%)		
皮膚・皮膚付属器障害	5 (0.67)	7 (0.07)	12 (0.11)
発疹	4 (0.54)	4 (0.04)	8 (0.08)
蕁麻疹		1 (0.01)	1 (0.01)
皮膚落屑性紅斑	1 (0.13)		1 (0.01)
かゆみ		1 (0.01)	1 (0.01)
蕁麻疹		1 (0.01)	1 (0.01)
筋・骨格系障害	1 (0.13)		1 (0.01)
筋肉痛	1 (0.13)		1 (0.01)
膠原病	2 (0.27)		2 (0.02)
抗核抗体陽性化	2 (0.27)		2 (0.02)
中枢・末梢神経系障害	57 (7.67)	75 (0.76)	132 (1.24)
頭痛	16 (2.15)	12 (0.12)	28 (0.26)
頭重 (感)		6 (0.06)	6 (0.06)
血管性頭痛		1 (0.01)	1 (0.01)
めまい	21 (2.83)	21 (0.21)	42 (0.40)
眩暈		2 (0.02)	2 (0.02)
めまい [起立性]		2 (0.02)	2 (0.02)
めまい感		1 (0.01)	1 (0.01)
ふらつき (感)		8 (0.08)	8 (0.08)
ふらふら (感)		3 (0.03)	3 (0.03)
立ちくらみ	19 (2.56)	22 (0.22)	41 (0.39)
昏迷		1 (0.01)	1 (0.01)
しびれ (感)		1 (0.01)	1 (0.01)
しびれ (感) [手指]		1 (0.01)	1 (0.01)
こわばり [手足の]		1 (0.01)	1 (0.01)
肩こり	2 (0.27)	1 (0.01)	3 (0.03)
冷感	2 (0.27)		2 (0.02)

自律神経系障害	20 (2.69)	22 (0.22)	42 (0.40)
動悸	16 (2.15)	16 (0.16)	32 (0.30)
心悸亢進	1 (0.13)	2 (0.02)	3 (0.03)
頻脈	1 (0.13)	2 (0.02)	3 (0.03)
口渇	1 (0.13)	4 (0.04)	5 (0.05)
発汗	3 (0.40)		3 (0.03)
視覚障害	2 (0.27)	3 (0.03)	5 (0.05)
目の違和感	2 (0.27)		2 (0.02)
眼の異常		2 (0.02)	2 (0.02)
視調節障害		1 (0.01)	1 (0.01)
精神障害	5 (0.67)	5 (0.05)	10 (0.09)
眠気	1 (0.13)	4 (0.04)	5 (0.05)
不眠	3 (0.40)		3 (0.03)
言語のおっくうさ	1 (0.13)		1 (0.01)
いらいら感		1 (0.01)	1 (0.01)
消化管障害	19 (2.56)	23 (0.23)	42 (0.40)
悪心	2 (0.27)	2 (0.02)	4 (0.04)
嘔気		4 (0.04)	4 (0.04)
嘔吐	3 (0.40)		3 (0.03)
食欲不振	1 (0.13)	1 (0.01)	2 (0.02)
食思不振		1 (0.01)	1 (0.01)
便秘	3 (0.40)	1 (0.01)	4 (0.04)
下痢	5 (0.67)	3 (0.03)	8 (0.08)
腹痛	5 (0.67)	2 (0.02)	7 (0.07)
心窩部痛		2 (0.02)	2 (0.02)
消化不良	1 (0.13)		1 (0.01)
胃膨満		2 (0.02)	2 (0.02)
胸やけ		1 (0.01)	1 (0.01)
口唇炎		1 (0.01)	1 (0.01)
口角炎		1 (0.01)	1 (0.01)
歯肉 (齦) 炎		1 (0.01)	1 (0.01)
舌荒れ		1 (0.01)	1 (0.01)
肝臓・胆管系障害	4 (0.54)	8 (0.08)	12 (0.11)
AST (GOT) 上昇	3 (0.40)	4 (0.04)	7 (0.07)
ALT (GPT) 上昇	3 (0.40)	6 (0.06)	9 (0.08)
肝機能検査異常		1 (0.01)	1 (0.01)
肝障害		1 (0.01)	1 (0.01)
Al-P 上昇	1 (0.13)		1 (0.01)
総ビリルビン上昇	1 (0.13)		1 (0.01)

代謝・栄養障害	1 (0.13)	8 (0.08)	9 (0.08)
LDH 上昇	1 (0.13)		1 (0.01)
血糖値上昇	1 (0.13)		1 (0.01)
血清脂質増加		1 (0.01)	1 (0.01)
ナトリウム上昇 [血中]		1 (0.01)	1 (0.01)
血中尿酸上昇		2 (0.02)	2 (0.02)
血清クロル上昇		1 (0.01)	1 (0.01)
高トリグリセライド血症		2 (0.02)	2 (0.02)
低カリウム血症		1 (0.01)	1 (0.01)
コレステロール上昇 [血清]		1 (0.01)	1 (0.01)
心・血管障害	1 (0.13)	10 (0.10)	11 (0.10)
血圧上昇	1 (0.13)		1 (0.01)
起立性低血圧		8 (0.08)	8 (0.08)
低血圧		2 (0.02)	2 (0.02)
心筋・心内膜・心膜・弁膜障害	1 (0.13)		1 (0.01)
狭心症発作	1 (0.13)		1 (0.01)
心拍数・心リズム障害	5 (0.67)	3 (0.03)	8 (0.08)
不整脈	5 (0.67)	1 (0.01)	6 (0.06)
期外収縮 [心室性]		2 (0.02)	2 (0.02)
呼吸器系障害	5 (0.67)	3 (0.03)	8 (0.08)
鼻閉 (感)	2 (0.27)	3 (0.03)	5 (0.05)
息切れ	2 (0.27)		2 (0.02)
咽頭痛	1 (0.13)		1 (0.01)
赤血球障害		3 (0.03)	3 (0.03)
貧血		2 (0.02)	2 (0.02)
赤血球減少		1 (0.01)	1 (0.01)
白血球・網内系障害		3 (0.03)	3 (0.03)
リンパ節炎 [頸部]		1 (0.01)	1 (0.01)
白血球減少 (症)		1 (0.01)	1 (0.01)
白血球増多 (症)		1 (0.01)	1 (0.01)
泌尿器系障害	5 (0.67)	12 (0.12)	17 (0.16)
頻尿	2 (0.27)	2 (0.02)	4 (0.04)
夜間頻尿		1 (0.01)	1 (0.01)
乏尿感	1 (0.13)		1 (0.01)
尿失禁	1 (0.13)	4 (0.04)	5 (0.05)
BUN 上昇	1 (0.13)	1 (0.01)	2 (0.02)
血中クレアチニン上昇		3 (0.03)	3 (0.03)
尿量増加		2 (0.02)	2 (0.02)

一般的全身障害	23 (3.10)	23 (0.23)	46 (0.43)
ほてり	5 (0.67)	3 (0.03)	8 (0.08)
ほてり (顔の)		3 (0.03)	3 (0.03)
顔面潮紅		2 (0.02)	2 (0.02)
四肢熱感		1 (0.01)	1 (0.01)
熱感		1 (0.01)	1 (0.01)
のぼせ (感)		1 (0.01)	1 (0.01)
倦怠 (感)	6 (0.81)	2 (0.02)	8 (0.08)
倦怠 (感) [全身]		2 (0.02)	2 (0.02)
気分不良		2 (0.02)	2 (0.02)
むかつき感		1 (0.01)	1 (0.01)
脱力感	3 (0.40)		3 (0.03)
易疲労感	1 (0.13)	1 (0.01)	2 (0.02)
浮腫	6 (0.81)	2 (0.02)	8 (0.08)
浮腫 [下肢]		1 (0.01)	1 (0.01)
胸痛	3 (0.40)		3 (0.03)
胸苦しさ		1 (0.01)	1 (0.01)
圧迫感 [胸部]		1 (0.01)	1 (0.01)
胸部不快感		1 (0.01)	1 (0.01)
全身痛	1 (0.13)		1 (0.01)
右拇指痛	1 (0.13)		1 (0.01)
さむけ	1 (0.13)		1 (0.01)

②前立腺肥大症に伴う排尿障害（再審査終了時）

	承認時までの調査	承認時以降の調査	合計
調査施設数	81	740	807
調査症例数	365	5,396	5,761
副作用等の発現症例数	32	303	335
副作用等の発現件数	50	423	473
副作用等の発現症例率(%)	8.77	5.62	5.81
副作用等の種類	種類別発現症例（件数）率（%）		
皮膚・皮膚付属器障害	2 (0.55)	9 (0.17)	11 (0.19)
かゆみ		1 (0.02)	1 (0.02)
発疹	2 (0.55)	7 (0.13)	9 (0.16)
眼瞼そう痒感		1 (0.02)	1 (0.02)
筋・骨格系障害		1 (0.02)	1 (0.02)
骨痛		1 (0.02)	1 (0.02)
中枢・末梢神経系障害	18 (4.93)	200 (3.71)	218 (3.78)
昏迷		1 (0.02)	1 (0.02)
頭痛	3 (0.82)	8 (0.15)	11 (0.19)
頭重（感）		12 (0.22)	12 (0.21)
下肢しびれ（感）		2 (0.04)	2 (0.03)
しびれ（感）		1 (0.02)	1 (0.02)
めまい	12 (3.29)	67 (1.24)	79 (1.37)
立ちくらみ	6 (1.64)	104 (1.93)	110 (1.91)
ふらつき（感）		59 (1.09)	59 (1.02)
自律神経系障害	1 (0.27)	14 (0.26)	15 (0.26)
口渇		2 (0.04)	2 (0.03)
動悸		12 (0.22)	12 (0.21)
寝汗		1 (0.02)	1 (0.02)
冷汗	1 (0.27)	1 (0.02)	2 (0.03)
視覚障害	2 (0.55)	1 (0.02)	3 (0.05)
眼球乾燥		1 (0.02)	1 (0.02)
目の違和感	2 (0.55)		2 (0.03)
聴覚・前庭障害	1 (0.27)		1 (0.02)
耳鳴	1 (0.27)		1 (0.02)

精神障害		9 (0.17)	9 (0.16)
あくび		1 (0.02)	1 (0.02)
眠気		4 (0.07)	4 (0.07)
不眠 (症)		2 (0.04)	2 (0.03)
抑うつ状態		1 (0.02)	1 (0.02)
浮遊感		1 (0.02)	1 (0.02)
消化管障害	4 (1.10)	27 (0.50)	31 (0.54)
嘔気	2 (0.55)	4 (0.07)	6 (0.10)
むかつき		1 (0.02)	1 (0.02)
嘔吐		2 (0.04)	2 (0.03)
ゲップ		1 (0.02)	1 (0.02)
下痢		3 (0.06)	3 (0.05)
胃もたれ感		1 (0.02)	1 (0.02)
胸やけ		2 (0.04)	2 (0.03)
食欲不振		2 (0.04)	2 (0.03)
腹痛	2 (0.55)	4 (0.07)	6 (0.10)
胃不快感		5 (0.09)	5 (0.09)
胃痛		1 (0.02)	1 (0.02)
腹部不快感		1 (0.02)	1 (0.02)
便秘	1 (0.27)	1 (0.02)	2 (0.03)
肝臓・胆管系障害	4 (1.10)	10 (0.19)	14 (0.24)
A1-P 上昇	3 (0.82)	1 (0.02)	4 (0.07)
AST (GOT) 上昇	2 (0.55)	6 (0.11)	8 (0.14)
ALT (GPT) 上昇	2 (0.55)	8 (0.15)	10 (0.17)
ビリルビン値上昇	1 (0.27)		1 (0.02)
代謝・栄養障害	2 (0.55)	6 (0.11)	8 (0.14)
LDH 上昇	1 (0.27)	1 (0.02)	2 (0.03)
口渇		1 (0.02)	1 (0.02)
血糖上昇		1 (0.02)	1 (0.02)
血中尿酸上昇	1 (0.27)		1 (0.02)
体重増加		1 (0.02)	1 (0.02)
血中コレステロール減少		2 (0.04)	2 (0.03)
HDL コレステロール低下		1 (0.02)	1 (0.02)
心・血管障害 (一般)	2 (0.55)	20 (0.37)	22 (0.38)
起立性低血圧		1 (0.02)	1 (0.02)
低血圧		6 (0.11)	6 (0.10)
血圧降下		3 (0.06)	3 (0.05)
血圧低下	2 (0.55)	10 (0.19)	12 (0.21)

心筋・心内膜・心膜・弁膜障害		2 (0.04)	2 (0.03)
狭心症発作		1 (0.02)	1 (0.02)
狭心痛		1 (0.02)	1 (0.02)
心拍数・心リズム障害		2 (0.04)	2 (0.03)
不整脈		2 (0.04)	2 (0.03)
血管（心臓外）障害		1 (0.02)	1 (0.02)
下肢冷感		1 (0.02)	1 (0.02)
呼吸器系障害		3 (0.06)	3 (0.05)
息切れ		1 (0.02)	1 (0.02)
鼻閉		1 (0.02)	1 (0.02)
鼻血		1 (0.02)	1 (0.02)
赤血球障害	1 (0.27)	8 (0.15)	9 (0.16)
血色素減少		2 (0.04)	2 (0.03)
赤血球減少	1 (0.27)	7 (0.13)	8 (0.14)
ヘマトクリット値減少	1 (0.27)	8 (0.15)	9 (0.16)
ヘモグロビン減少	1 (0.27)	5 (0.09)	6 (0.10)
白血球・網内系障害	1 (0.27)	1 (0.02)	2 (0.03)
白血球減少（症）	1 (0.27)	1 (0.02)	2 (0.03)
血小板・出血凝血障害		1 (0.02)	1 (0.02)
血小板減少（症）		1 (0.02)	1 (0.02)
泌尿器系障害	1 (0.27)	7 (0.13)	8 (0.14)
クレアチニン上昇〔血中〕	1 (0.27)		1 (0.02)
蛋白尿		1 (0.02)	1 (0.02)
尿失禁		5 (0.09)	5 (0.09)
BUN 上昇	1 (0.27)		1 (0.02)
頻尿〔夜間〕		1 (0.02)	1 (0.02)
男性生殖（器）障害		4 (0.07)	4 (0.07)
インポテンス		4 (0.07)	4 (0.07)
一般的全身障害		20 (0.37)	20 (0.35)
胸痛		1 (0.02)	1 (0.02)
胸内苦悶感		2 (0.04)	2 (0.03)
疼痛		1 (0.02)	1 (0.02)
易疲労感		2 (0.04)	2 (0.03)
気分不良		2 (0.04)	2 (0.03)
倦怠（感）〔全身〕		3 (0.06)	3 (0.05)
浮腫		1 (0.02)	1 (0.02)
ほてり		3 (0.06)	3 (0.05)
下肢浮腫		4 (0.07)	4 (0.07)
脱力（感）		1 (0.02)	1 (0.02)

[臨床検査値異常一覧]

高血圧症及び前立腺肥大症に伴う排尿障害に対する承認時までの臨床試験の結果, 臨床検査値異常の発現件数は因果関係不明例も含め, 下記のとおりである.

項 目		異常発現症例数/調査症例数 (%)		
		高血圧症※	前立腺肥大症に伴う排尿障害	
血液検査	赤血球数	3/629 (0.48)	4/284 (1.41)	
	白血球数	17/628 (2.71)	3/285 (1.05)	
	桿状核球	5/406 (1.23)	-	
	分節核球	5/406 (1.23)	-	
	好中球	2/457 (0.44)	-	
	リンパ球	11/457 (2.41)	-	
	好塩基球	1/455 (0.22)	-	
	好酸球	10/455 (2.20)	-	
	単球	6/456 (1.32)	-	
	ヘモグロビン	1/626 (0.16)	2/285 (0.70)	
	ヘマトクリット	1/621 (0.16)	4/285 (1.40)	
	血小板数	1/582 (0.17)	1/281 (0.36)	
	血沈	6/229 (2.62)	-	
血液生化学検査	AST (GOT)	11/645 (1.71)	2/289 (0.69)	
	ALT (GPT)	13/645 (2.02)	4/289 (1.38)	
	Al-P	3/635 (0.47)	5/280 (1.79)	
	LDH	10/640 (1.56)	3/285 (1.05)	
	総ビリルビン	2/518 (0.39)	2/279 (0.72)	
	BUN	22/642 (3.43)	3/290 (1.03)	
	血清クレアチニン	19/603 (3.15)	3/289 (1.04)	
	総コレステロール	8/636 (1.26)	3/243 (1.23)	
	尿酸	14/630 (2.22)	6/266 (2.26)	
	CPK	6/154 (3.90)	2/112 (1.79)	
	電解質	K	4/642 (0.62)	-
		Ca	1/45 (2.22)	-
P		3/44 (6.82)	-	
空腹時血糖	5/321 (1.56)	-		
尿検査	24時間尿	クレアチンクリアランス	1/22 (4.55)	-
		K	1/16 (6.25)	-
	スポット尿	蛋白	6/593 (1.01)	2/286 (0.70)
		沈渣	6/505 (1.19)	1/283 (0.35)
その他	PSP	1/18 (5.56)	-	
	PRA	1/23 (4.35)	-	
	抗核抗体	5/120 (4.17)	1/7 (14.29)	

※本態性高血圧症, 腎性高血圧症, 褐色細胞腫による高血圧症

(3) 基礎疾患、合併症、重症度及び手術の有無等背景別の副作用発現頻度

アレルギー体質別副作用発現症例率

①高血圧症

		症例数	副作用発現症例数	副作用発現件数	副作用発現症例率 (%)	検定結果 (χ^2)
アレルギー体質	あり	277	15	26	5.42	P < 0.01
	なし	9,404	165	199	1.75	
	不明	29	0	0	0.00	—
	未記載	173	1	1	0.58	

②前立腺肥大症に伴う排尿障害

		症例数	副作用発現症例数	副作用発現件数	副作用発現症例率 (%)	検定結果 (χ^2)
アレルギー体質	あり	115	14	21	12.17	P < 0.002
	なし	5,280	289	402	5.47	
	不明	1	0	0	0.00	—

(4) 薬物アレルギーに対する注意及び試験法

「2. 禁忌内容とその理由」「6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法」「8. 副作用 (1) -2)」の項参照.

試験法については該当資料なし.

9. 高齢者への投与

高齢者では、一般に過度の降圧は好ましくないとされている（脳梗塞等が起こるおそれがある）ので、低用量（例えば1回0.25 mg, 1日2回）から投与を開始するなど患者の状態を観察しながら慎重に投与すること。

10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

(1) 妊婦又は妊娠している可能性のある婦人には、治療上の有益性が危険性を上回ると判断される場合にのみ投与すること。〔妊娠中の投与に関する安全性は確立していない。〕
 (2) 授乳中の婦人に投与する場合には授乳を中止させることが望ましい。〔動物実験（ラット）で乳汁中への移行が報告されている。〕

11. 小児等への投与

小児等に対する安全性は確立していない（使用経験が少ない）。

12. 臨床検査結果に及ぼす影響

「8. 副作用（2）項目別副作用発現頻度及び臨床検査値異常一覧」の項参照

13. 過量投与

本剤の過量投与により過度の血圧低下を起こす可能性がある。このような症状があらわれた場合には、体位を仰臥位にするほか、必要に応じて輸液、昇圧剤の投与等適切な処置を行うこと。なお、血液透析は本剤の除去に有効ではない。

14. 適用上及び薬剤交付時の注意（患者等に留意すべき必須事項等）

適用上の注意

薬剤交付時 PTP 包装の薬剤は PTP シートから取り出して服用するよう指導すること。

[PTP シートの誤飲により、硬い鋭角部が食道粘膜へ刺入し、更には穿孔をおこして縦隔洞炎等の重篤な合併症を併発することが報告されている。]

- 1) 投与初期又は用量の急増時等に、めまい、立ちくらみ、動悸、頭痛等があらわれることがある。
その際には仰臥位をとらせるなどの適切な措置を講ずること。
また、必要に応じて対症療法を行うこと。「6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法」の項参照。
- 2) 降圧作用に基づくめまい等があらわれることがあるので、高所作業、自動車の運転等危険を伴う機械を操作する際には注意させること。「6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法」の項参照。

15. その他の注意

その他の注意

- (1) 類似化合物（プラゾシン塩酸塩）で腎及びその他の動脈狭窄、脚部及びその他の動脈瘤等の血管障害のある高血圧症患者で、急性熱性多発性関節炎がみられた1例報告がある。
- (2) ラットに 250 mg/kg/日（臨床最大用量の約 1,800 倍に相当）を2年間経口投与した試験で、雄のみに良性副腎髄質腫瘍の発生頻度が対照群に比し高いとの報告がある。

16. その他
該当しない

Ⅸ. 非臨床試験に関する項目

1. 一般薬理^{27~29)}

一般薬理試験において、マウスの経口投与では眼瞼下垂及び自発運動の低下が認められた。ラットにおいては体温下降、胃液及び胆汁分泌量の減少並びに食塩負荷時の尿排泄量の抑制が認められた。これらの作用は α 遮断作用あるいは血圧低下に基づく二次的な影響と考えられ、プラゾシン塩酸塩でも同様に認められた。そのほか、中枢神経系、体性神経系、自律神経系、生殖器系、血液系等に対する影響はないか、あっても有効用量に比し高用量における作用であった。従って、一般薬理試験の結果からは血圧低下に基づく二次的な影響以外、特に臨床上問題となるような作用は見いだされなかった。

2. 毒性

(1) 単回投与毒性試験³⁰⁾

動物種	性	LD ₅₀ (mg/kg)		
		経口	皮下	静脈内
マウス (ICR)	♂	>8,000	1,523	237
	♀	>8,000	956	262
ラット (Wistar)	♂	>8,000	1,163	350
	♀	>8,000	1,050	361

(2) 反復投与毒性試験^{31~33)}

Wistar ラット (70, 200, 550, 1,500 mg/kg, 1 ヶ月, 経口) では、200 mg/kg 以上で胸腺重量の減少、副腎重量の増加などがみられ、550 mg/kg 以上では自発運動の減少、体重の増加抑制など、1,500 mg/kg では肝及び腎重量の増加などがみられた。毒性学的無影響量は 70 mg/kg であった。

ビーグル犬 (5, 10, 20, 40 mg/kg, 5 週間, 経口) では、20 mg/kg 以上で心拍数の増加、活動性の低下などがみられたが、臓器重量、病理組織学的検査において異常はみられなかった。毒性学的無影響量は 10 mg/kg であった。

Wistar ラット (3, 10, 30, 100 mg/kg, 6 ヶ月, 経口) では、10 mg/kg 以上で AST (GOT), ALT (GPT) の減少、脾臓のうっ血、30 mg/kg では副腎及び腎重量の増加、100 mg/kg では体重増加抑制、肝重量の増加が認められたが、これらの変化は 1 ヶ月間の休薬により回復した。毒性学的無影響量は 3 mg/kg であった。

ビーグル犬 (2.4, 7, 20 mg/kg, 12 ヶ月, 経口) では、各投与群とも臓器重量、病理組織学的検査において異常はみられなかった。毒性学的無影響量は 20 mg/kg であった。

(3) 生殖発生毒性試験^{34~36)}

Wistar ラットの妊娠前及び妊娠初期、器官形成期に 3, 30, 300 mg/kg を経口投与した結果、300 mg/kg において親動物の一般毒性学的変化に伴う胎仔死亡、発育抑制などがみられたが、催奇形性は認められなかった。周産期及び授乳期に 3, 25, 200 mg/kg 経口投与した結果、25 mg/kg 以上で新生仔の生後発達の抑制、200 mg/kg で新生仔の出生率及び生後 3

日の生存率の低下，交尾率の低下がみられた。

(4) その他の特殊毒性

1) 変異原性

テラゾシン塩酸塩水和物の変異原性を細菌を用いた復帰変異試験，*in vitro*における染色体異常誘発試験及びマウスを用いた小核試験で検討した結果，細菌に対して変異誘発性はみられなかったが，*in vitro* 染色体異常誘発試験において S9 共存下でのみ弱い染色体異常誘発性がみられた。しかし，小核試験では染色体異常誘発性はみられなかった。

2) がん原性

ラットを用いた2年間の混餌投与試験において，雄の最高用量にて良性副腎髄質腫瘍の発現率の増加がみられた。しかし，この腫瘍は，ラットで自然発症が比較的高いこと，ラットの副腎髄質の機能・形態がヒトと異なる可能性があること，ヒトの推定臨床用量に比べて極めて高用量（1,800倍）で発現していることより，ヒトにおける発現の可能性を示唆するものではないと考えられている。

3) 抗原性³⁷⁾

テラゾシン塩酸塩水和物の抗原性をモルモット（アナフィラキシー反応，シュルツディール反応，PCA反応，PHA反応）及びマウス（PCA反応）を用いて試験した結果，抗原性はみられなかった。

X. 取扱い上の注意等に関する項目

1. 有効期間又は使用期限

使用期限：製造後 5 年

ラベル，ケースに記載

2. 貯法・保存条件

室温保存

3. 薬剤取扱い上の注意点

処方箋医薬品

4. 承認条件

該当しない

5. 包装

ハイトラシン錠 0.25 mg (PTP) 100 錠，1,000 錠

ハイトラシン錠 0.5 mg (PTP) 100 錠，1,000 錠

ハイトラシン錠 1 mg (PTP) 100 錠，1,000 錠

ハイトラシン錠 2 mg (PTP) 100 錠

6. 同一成分・同効薬

同一成分薬：バソメット錠（田辺三菱）

同 効 薬：本態性高血圧症，腎性高血圧症，褐色細胞腫による高血圧症：

プラゾシン塩酸塩，ブナゾシン塩酸塩，ウラピジル，ドキサゾシンメシル酸塩

前立腺肥大症に伴う排尿障害：

プラゾシン塩酸塩，ウラピジル，タムスロシン塩酸塩，ナフトピジル

7. 国際誕生年月日

1984 年 11 月 30 日

8. 製造販売承認年月日及び承認番号

承認年月日：1989 年 3 月 31 日

承認番号：

錠 0.25 mg：20100AMY00049000

錠 0.5 mg：20100AMY00050000

錠 1 mg：20100AMY00051000

錠 2 mg：20100AMY00052000

9. 薬価基準収載年月日

1989年5月26日

10. 効能・効果追加, 用法・用量変更追加等の年月日及びその内容

1994年10月5日 効能追加: 「前立腺肥大症に伴う排尿障害」

用法・用量: 前立腺肥大症に伴う排尿障害

テラゾシンとして通常, 成人1日1mg (1回0.5mg 1日2回) より投与を始め, 1日2mgに漸増し, 1日2回に分割経口投与する. なお, 症状により適宜増減する.

11. 再審査結果, 再評価結果公表年月日及びその内容

[再審査結果] 1998年3月12日 (高血圧症)

2004年3月23日 (前立腺肥大症に伴う排尿障害)

厚生労働省医薬安全局長通知により「薬事法第14条第2項各号 (承認拒否理由) のいずれにも該当しない」

12. 再審査期間

(高血圧症) 1989年3月31日~1995年3月30日 (終了)

(前立腺肥大症に伴う排尿障害) 1994年10月5日~1998年10月4日 (終了)

13. 長期投与の可否

本剤は, 投与期間に上限が設けられている医薬品に該当しない.

14. 厚生労働省薬価基準収載医薬品コード

ハイトラシン錠 0.25 mg : 2149023F1022

ハイトラシン錠 0.5 mg : 2149023F2029

ハイトラシン錠 1 mg : 2149023F3025

ハイトラシン錠 2 mg : 2149023F4021

15. 保険給付上の注意

該当しない

XI. 文献

1. 引用文献

- 1) 金子好宏 ほか：臨床と研究, 65 (1), 242 (1988)
- 2) 吉永 馨 ほか：薬理と治療, 16 (3), 1245 (1988)
- 3) 武田忠直 ほか：薬理と治療, 15 (7), 2861 (1987)
- 4) 吉永 馨 ほか：薬理と治療, 15 (7), 2835 (1987)
- 5) 池田正男 ほか：薬理と治療, 15 (7), 2887 (1987)
- 6) 吉永 馨 ほか：医学と薬学, 17 (5), 1242 (1987)
- 7) 熊本悦明 ほか：泌尿器外科, 5 (8), 721 (1992)
- 8) 熊本悦明 ほか：泌尿器外科, 5 (9), 823 (1992)
- 9) 朴 英哲 ほか：泌尿紀要, 38 (7), 857 (1992)
- 10) 熊本悦明 ほか：泌尿器外科, 5 (9), 841 (1992)
- 11) 海老原昭夫 ほか：臨床医薬, 3 (6), 667 (1987)
- 12) 海老原昭夫 ほか：臨床医薬, 3 (6), 681 (1987)
- 13) 吉永 馨 ほか：薬理と治療, 15 (7), 2819 (1987)
- 14) 石井當男 ほか：Prog. Med., 7 (7), 1331 (1987)
- 15) 金子好宏 ほか：臨床と研究, 65 (1), 229 (1988)
- 16) Nagatomo, T., et al. : Chem. Pharm. Bull., 35, 1629 (1987)
- 17) 花塚光男 ほか：日薬理誌, 88, 433 (1986)
- 18) 森田 隆 ほか：J. Smooth Muscle Res., 27, 149 (1991)
- 19) 溝上 進 ほか：応用薬理, 33 (1), 81 (1987)
- 20) 堀井大治郎 ほか：応用薬理, 33 (1), 165 (1987)
- 21) 西沢 理 ほか：J. Smooth Muscle Res., 28, 55 (1992)
- 22) 近藤厚生 ほか：泌尿器外科, 5 (5), 441 (1992)
- 23) 供田文宏 ほか：循環の計測と制御, 5, 22 (1986)
- 24) 柴田邦彦 ほか：応用薬理, 33 (5), 775 (1987)
- 25) 内出政之 ほか：薬理と治療, 15 (4), 1513 (1987)
- 26) 武田忠直 ほか：薬理と治療, 15 (7), 2921 (1987)
- 27) 堀井大治郎 ほか：応用薬理, 33 (4), 599 (1987)
- 28) 堀井大治郎 ほか：医薬品研究, 18 (2), 218 (1987)
- 29) Kyncl J. J. : Am. J. Med., 80 (suppl. 5B), 12 (1986)
- 30) 長瀬美智子 ほか：医薬品研究, 18 (4), 505 (1987)
- 31) 三井田均司 ほか：医薬品研究, 18 (4), 514 (1987)
- 32) 永田良一 ほか：医薬品研究, 18 (2), 273 (1987)
- 33) 三井田均司 ほか：医薬品研究, 18 (4), 532 (1987)
- 34) 池田保男 ほか：医薬品研究, 18 (3), 419 (1987)
- 35) 池田保男 ほか：医薬品研究, 18 (3), 427 (1987)
- 36) 岩瀬隆文 ほか：医薬品研究, 18 (4), 622 (1987)
- 37) 長谷川隆司 ほか：J. Toxicol. Sci., 12 (suppl. I), 35 (1987)
- 38) 前波輝彦 ほか：透析会誌, 26 (3), 339 (1993)

2. その他の参考文献

該当資料なし

X II. 参考資料

主な外国での発売状況

カナダ (2010.12)

販売名	会社名	剤 型	規格	適応症
Hytrin	Abbott	錠剤	1 mg 2 mg 5 mg 10 mg	高血圧症 前立腺肥大症

英国 (出典：MIMS June 2008)

販売名	会社名	剤 型	規格	適応症
Hytrin	Amdipharm	錠剤	2 mg 5 mg 10 mg	高血圧症 前立腺肥大症

日本病院薬剤師会の IF 様式に基づいて作成

XⅢ. 備 考

その他の関連資料

該当資料なし

文献請求先

マイランEPD合同会社 くすり相談室

〒105-0001 東京都港区虎ノ門5丁目11番2号

フリーダイヤル 0120-938-837

